516,743

# PATENT COOPERATION TREATY

## **PCT**

## INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

anslation internat	PATENT COOPERAT		ATY	PCT/JP2003/C
anslat.	PCI			<b>-</b>
INTERNAT	TIONAL PRELIMINAR	Y EXAMINA	ATION KEP	ORT
	(PCT Article 36 at	<del> </del>		
Applicant's or agent's file reference RFH1505-1559	FOR FURTHER ACTION	See Notific Preliminary	cation of Tra Examination Re	insmittal of Internation port (Form PCT/IPEA/4)
International application No.	International filing date (day	· ·	1	day/month/year)
PCT/JP2003/007189  International Patent Classification (IPC) or	06 June 2003 (06.0	6.2003)	0 / June	2002 (07.06.2002)
C07D 491/044, A61K 31/407,	A61P 35/00			
Applicant				
	RIKEN			
This international preliminary exa and is transmitted to the applicant	amination report has been prepart according to Article 36.	ed by this Interr	national Prelimi	nary Examining Authorit
2. This REPORT consists of a total	of 3 sheets, inclu	ding this cover s	sheet.	
amended and are the basis	anied by ANNEXES, i.e., sheets for this report and/or sheets corthe Administrative Instructions to	itaining rectifica	on, claims and/o	or drawings which have b fore this Authority (see I
	a total ofsheets			
This report contains indications report.	relating to the following items:			
I Basis of the repo				
II Priority				
III Non-establishme	ent of opinion with regard to nov	elty, inventive s	tep and industric	al applicability
IV Lack of unity of				
V Reasoned statem citations and exp	ent under Article 35(2) with reg lanations supporting such stater	ard to novelty, in nent	nventive step or	industrial applicability;
VI Certain documen	nts cited			
VII Certain defects in	n the international application			
VIII Certain observati	tions on the international applica	tion		
Date of submission of the demand	Da	te of completion	of this report	
25 November 2003 (2	5.11.2003)	01	April 2004	(01.04.2004)
Name and mailing address of the IPEA/	JP Au	thorized officer		
Facsimile No.	Te	ephone No.		



## INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT PCT/IP200

International application No.

## PCT/JP2003/007189

I. Basis of the report					
1. With regard to the elements of the international application:*					
the international application as originally filed					
the description:					
pages, as originally filed					
pages, filed with the demand					
pages, filed with the letter of					
the claims:					
nages					
pages, as amended (together with any statement under Article 19					
pages, filed with the demand					
pages, filed with the letter of					
the drawings:					
pages, as originally filed pages, filed with the demand					
pages, filed with the demand					
the sequence listing part of the description:					
pages, as originally filed					
pages, filed with the demand					
pages, filed with the letter of					
<ol> <li>With regard to the language, all the elements marked above were available or furnished to this Authority in the language in whithe international application was filed, unless otherwise indicated under this item.         These elements were available or furnished to this Authority in the following language</li></ol>					
the language of a translation furnished for the purposes of international search (under Rule 23.1(b)).					
the language of publication of the international application (under Rule 48.3(b)).					
the language of the translation furnished for the purposes of international preliminary examination (under Rule 55.2 and or 55.3).					
3. With regard to any nucleotide and/or amino acid sequence disclosed in the international application, the international preliminary examination was carried out on the basis of the sequence listing:					
contained in the international application in written form.					
filed together with the international application in computer readable form.					
furnished subsequently to this Authority in written form.					
furnished subsequently to this Authority in computer readable form.					
The statement that the subsequently furnished written sequence listing does not go beyond the disclosure in the international application as filed has been furnished.					
The statement that the information recorded in computer readable form is identical to the written sequence listing has been furnished.					
4. The amendments have resulted in the cancellation of:					
the description, pages					
the claims, Nos.					
the drawings, sheets/fig					
This report has been established as if (some of) the amendments had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c)).**					
* Replacement sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" and are not annexed to this report since they do not contain amendments (Rule 70.16)					
and 70.17).  ** Any replacement sheet containing such amendments must be referred to under item 1 and annexed to this report.					

#### INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No. PCT/JP 03/07189

V.	Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement				
1.	Statement				_
	Novelty (N)	Claims	2-7	YES	
		Claims	1, 8, 9	NO	
	Inventive step (IS)	Claims	5-7	YES	
		Claims	1-4, 8, 9	NO	
	Industrial applicability (IA)	Claims	1-9	YES	
		Claims		NO	

#### 2. Citations and explanations

Document 1: JP 8-269061 A

Document 2: Yuki Gosei Kagaku Kyokaishi (2000), 58 (3),

pp. 183-191

The inventions set forth in claims 1, 8 and 9 are not novel over documents 1 and 2, cited in the international search report. Document 1 discloses the antitumour substance epolactaene, and document 2 also discloses its optically active isomers, and these fall within the scope of the compounds in these inventions in the present invention. Similarly, the inventions set forth in claims 1-4, 8 and 9 do not involve an inventive step in the light of documents 1 and 2. The compounds in these inventions in the present application are such as could be obtained easily by a person skilled in the art by mere transesterification of the ester group of a compound such as epolactaene above.

The inventions set forth in claims 5-7 are not disclosed or suggested in documents 1 and 2 cited in the international search report, and are novel and involve an inventive step.

### 特 許 協 力 条 約

PCT

### 国際予備審査報告

(法第12条、法施行規則第56条) [PCT36条及びPCT規則70]

REC'D	22	APR 2004
WIPO		PCT

出願人又は代理人 の書類記号 RFH1505-1559	今後の手続きについては、国際予備審査 I PEA/4	報告の送付通知(様式PCT/ 16)を参照すること。			
国際出願番号 PCT/JP03/07189	国際出願日 (日.月.年) 06.06.2003	優先日 (日.月.年) 07.06.2002			
国際特許分類 (IPC) Int. Cl <sup>7</sup>	C07D491/044, A61K31	/407, A61P35/00			
出願人 (氏名又は名称) 理化学研究所					
1. 国際予備審査機関が作成したこの国	国際予備審査報告を法施行規則第57条(P(				
1					
	を含めて全部で3 ページ				
直域内に対してした前正を含む	風事類、つまり補正されて、この報告のま 明細書、請求の範囲及び/又は図面も添作	基礎とされた及び/又はこの国際予備審 すされている。			
(PCT規則70.16及びPCT) この附属書類は、全部で	実施細則第607号参照)				
3. この国際予備審査報告は、次の内容					
II 優先権					
│ Ⅲ [] 新規性、進歩性又は産業」 	この利用可能性についての国際予備審査報	告の不作成			
IV 開の単一性の欠如					
V X PCT35条(2)に規定す	ニュー・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・・				
の文献及び説明 VI					
VII 国際出願の不備					
VII 国際出願に対する意見					
		·			
<b>可</b> 做又					
国際予備審査の請求書を受理した日 25.11.2003	国際予備審査報告を作 01.	成した日 . 04. 2004			
名称及びあて先	特許庁審査官(権限の	ある職員) 4 B 8 6 1 5			
日本国特許庁 (IPEA/JP) 郵便番号100-8915	L				
東京都千代田区設が関三丁目4番3					

電話番号 03-3581-1101 内線

3448

## 国際予備審查報告

国際出願番号 PCT/JP03/07189

I、国際予備審査報告の基礎					
1. この国際予備審査報告は下記の出願審類に基づいて作成された。 (法第6条 (PCT14条) の規定に基づく命令に 応答するために提出された差し替え用紙は、この報告書において「出願時」とし、本報告書には添付しない。 PCT規則70.16,70.17)					
X 出願時の国際出願事類					
明細書     第     ページ、       明細書     第     ページ、       明細書     第     ページ、	出願時に提出されたもの 国際予備審査の請求むと共に提出されたもの 付の書簡と共に提出されたもの				
	出願時に提出されたもの PCT19条の規定に基づき補正されたもの				
請求の範囲 第 項、 請求の範囲 第 項、	国際予備審査の請求書と共に提出されたもの  一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一一				
図面       第       ページ/図、         .図面       第       ページ/図、         図面       第       ページ/図、	出願時に提出されたもの 国際予備審査の請求審と共に提出されたもの 付の書簡と共に提出されたもの				
明細書の配列表の部分 第       ページ、         明細書の配列表の部分 第       ページ、         明細書の配列表の部分 第       ページ、	出願時に提出されたもの 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの 				
2. 上記の出願書類の言語は、下記に示す場合を除くほか、こ	の国際出願の言語である。				
上記の書類は、下記の言語である 語であ	აგ.				
□ 国際調査のために提出されたPCT規則23.1(b)にいう翻訳文の言語 □ PCT規則48.3(b)にいう国際公開の言語 □ 国際予備審査のために提出されたPCT規則55.2または55.3にいう翻訳文の言語					
3. この国際出願は、ヌクレオチド又はアミノ酸配列を含んで					
この国際出願に含まれる書面による配列表 この国際出願と共に提出された磁気ディスクによる					
出願後に、この国際予備審査(または調査)機関に	提出された書面による配列表				
出願後に、この国際予備審査(または調査)機関に 出願後に提出した書面による配列表が出願時におけ	提出された磁気ディスクによる配列表 る国際出願の開示の範囲を超える事項を含まない旨の陳述				
書の提出があった  書面による配列表に記載した配列と磁気ディスクによる配列表に記録した配列が同一である旨の陳述書の提出があった。					
4. 補正により、下記の書類が削除された。					
	ージ/図				
5. 二 この国際予備審査報告は、補充欄に示したように、補正が出願時における開示の範囲を越えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。(PCT規則70.2(c) この補正を含む差し替え用紙は上記1. における判断の際に考慮しなければならず、本報告に添付する。)					

## 国際予備審査報告

国際出願番号 PCT/JP03/07189

				_
v.	新規性、進歩性又は産業上の利用可能 文献及び説明	性についての法第12条	(PCT35条(2)) に定	める見解、それを裏付ける
1.	見解			
	新規性 (N)	請求の範囲 請求の範囲	2-7 1, 8, 9	
	進歩性(IS) ·	語求の範囲 請求の範囲	5-7 1-4, 8, 9	
	産業上の利用可能性 (IA)	請求の範囲 請求の範囲	1-9	

### 2. 文献及び説明 (PCT規則70.7)

文献 1) JP 8-269061 A 2) Yuki Gosei Kagaku Kyokaishi (2000), 58(3), 183-191

請求の範囲 1, 8, 9の発明は、国際調査報告で引用された文献 1, 2により新規性を有さない。文献 1には、抗腫瘍性物質エポラクタンが記載され、文献 2にはその光学活性体も記載されており、これらのものは、本願発明化合物に該当するものである。また、請求の範囲 1-4, 8, 9の発明は、文献 1, 2により進歩性を有さない。本願発明化合物は、上記エポラクタン等のエステル基をエステル交換することにより当業者が容易に製造し得たものというほかはない。

請求の範囲5-7の発明は、国際調査報告で引用された文献1,2には記載も示唆もされておらず、新規性及び進歩性を有する。